

Н. В. Красникова, С. В. Красников,  
Н. Г. Герасимов

Ярославский государственный технический университет,  
150023, Россия, г. Ярославль, Московский пр., 88,  
natalia.kamkina@yandex.ru

**СИНТЕЗ БИОЛОГИЧЕСКИ АКТИВНЫХ  
 $\alpha,\beta$ -ФУНКЦИОНАЛИЗИРОВАННЫХ *n*-АЛКИЛ-  
И *n*-ЦИКЛОАЛКИЛБЕНЗОЙНЫХ КИСЛОТ НА ОСНОВЕ  
4-ОКСИРАНИЛБЕНЗОЙНЫХ КИСЛОТ**

**Ключевые слова:**  $\alpha,\beta$ -функционализованные *n*-алкил и *n*-циклоалкилбензойные кислоты, 4-оксиранилбензойная кислота, *N,O*-нуклеофилы, анксиолитическая активность,  $\beta$ -региоизомер.

$\alpha,\beta$ -Функционализованные *n*-алкил и *n*-циклоалкилбензойные кислоты представляют практический интерес, так как содержат, например, в своем составе фрагмент  $\alpha$ -арил- $\beta$ -аминоспиртов, который обладает выраженной биологической активностью, например, антигистаминной, антиаритмической, противопаркинсонической и т. д., и относится к биогенным аминам [1–5].

Целью данного исследования являлось получение ряда новых биологически активных  $\alpha,\beta$ -функционализованных *n*-алкил и *n*-циклоалкилбензойных кислот на основе 4-оксиранилбензойных кислот (**1a,b**).

4-(2-Метил-2-оксиранил)бензойная и 4-пергидро-1-бензоксирен-1-илбензойная кислоты (**1a,b**) были синтезированы окислением 4-изопропенил- и 4-циклогексенилбензойных кислот надуксусной кислотой [6].

В настоящей работе было исследовано взаимодействие кислот **1a,b** с различными *N,O*-нуклеофилами (рисунок). В качестве *N*-нуклеофилов были выбраны вторичные амины (пирролидин, морфолин, диэтиламин), нитрит натрия, а *O*-нуклеофилов – феноксид и гидроксид натрия.

Наличие третичной гидроксильной группы в продуктах **2-7a,b** подтверждалось ИК-спектрами, в которых присутствовали широкие интенсивные полосы поглощения валентных колебаний -ОН групп при 3310–3370 см<sup>-1</sup> и валентные колебания связи С-О в области 1100–1170 см<sup>-1</sup>.

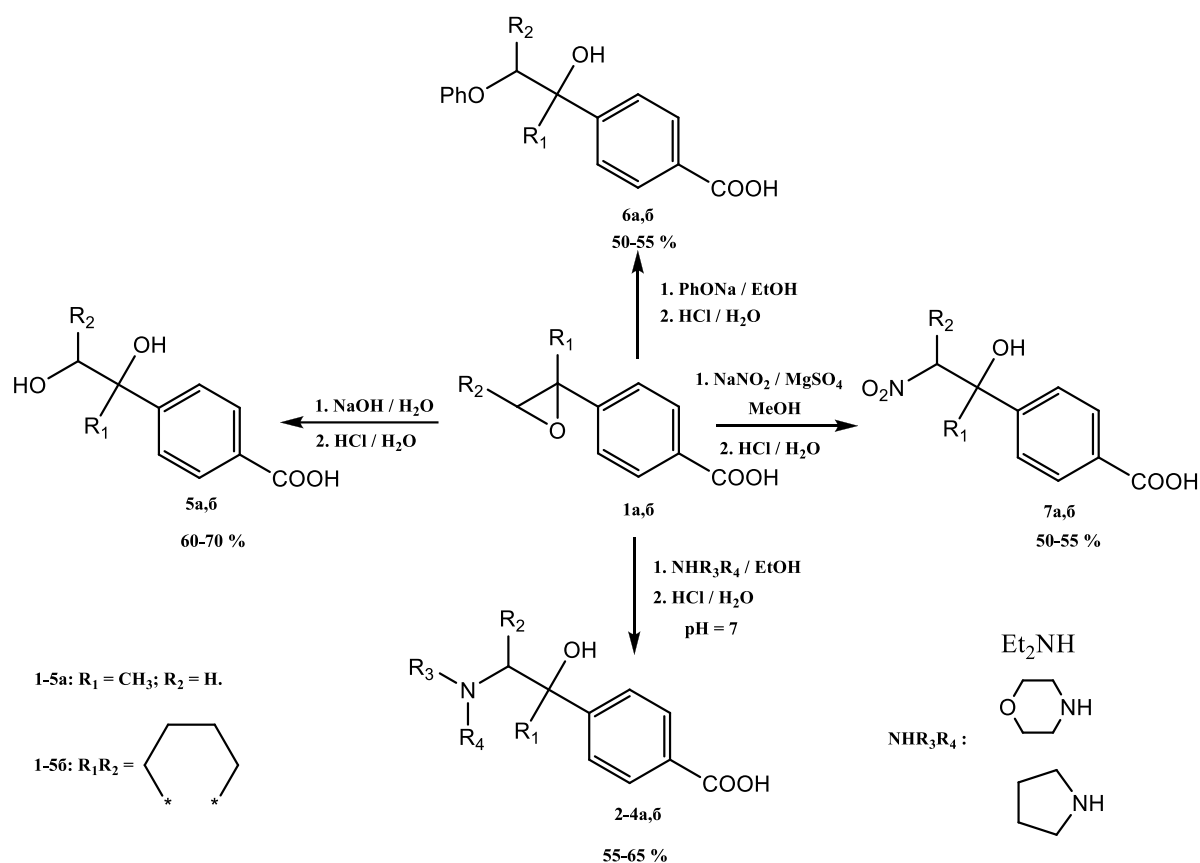


Рисунок. Взаимодействие 4-оксиранилбензойных кислот **1a,b** с *N,O*-нуклеофилами

Соединения **2-4a,b** в испытаниях *in vivo* показали наличие анксиолитической (транквилизирующей) активности без проявления седативного действия, что характерно для группы дневных транквилизаторов [7].

Анализом  $^1\text{H}$  ЯМР-спектроскопией было доказано образование продуктов **2-4a,b** в виде  $\beta$ -региоизомеров и соединений **5a,b** исключительно в виде *транс*-дио́лов. Синтез продуктов **7a,b** протекал неселективно с образованием смеси  $\beta$ -нитроспирт/дигидроксикислота/алкоксиспирт в соотношении 5/3/2.

#### Список литературы

1. Klein M., Krainz K., Redwan I. N. et al. // *Molecules*. 2009. Vol. 14. P. 5124–5143.
2. Priyanka V., Sing E., Diksha K. // *Bioorganic Chemistry*. 2017. Vol. 71. P. 120–127.
3. Fábíode S., Fernandes T., Fernandes S. et al. // *European Journal of Medicinal Chemistry*. 2016. Vol. 108. P. 203–210.
4. Meirong J., Tao W., Kanghui Y. et al. // *Mini-Reviews in Organic Chemistry*. 2011. Vol. 8. P. 197–210.
5. Kowalczyk R., Kwiatkowski P., Skarzewski J. et al. // *J. Org. Chem.* 2009. Vol. 74. P. 753–756.
6. Камкина Н. В., Красников С. В., Фролова Е. Е. // *Известия вузов. Химия и химическая технология*. 2011. Т. 54, вып. 6. С. 74–75.
7. Камкина Н. В., Красников С. В. [Электронный ресурс] // *Современные проблемы науки и образования*. 2014. № 6. URL: [www.science-education.ru/120-16518](http://www.science-education.ru/120-16518).